

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】平成 20 年 2 月 14 日 (2008.2.14)

【公表番号】特表 2007-519660 (P2007-519660A)

【公表日】平成 19 年 7 月 19 日 (2007.7.19)

【年通号数】公開・登録公報 2007-027

【出願番号】特願 2006-550028 (P2006-550028)

【国際特許分類】

C 0 7 D 451/02 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 451/02

【手続補正書】

【提出日】平成 19 年 12 月 13 日 (2007.12.13)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

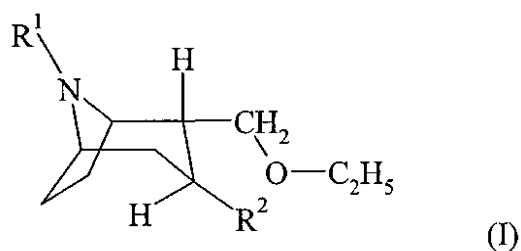
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) の 2 - (エトキシメチル) - トロパン誘導体又は薬剤として許容されるその塩を調製する方法であって、

【化 1】



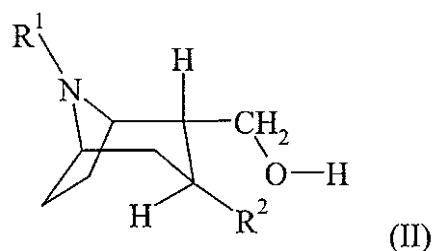
[式中、

R¹ は、水素又は C₁ - 6 アルキルを表し、

R² は、ハロゲン、トリフルオロメチル、又はシアノで場合によって一置換若しくは多置換されたフェニルを表す]

塩基、相間移動触媒、及び場合によって希釈剤の存在下で、式 (II) の 2 - (ヒドロキシメチル) - トロパン誘導体

【化 2】



[式中、 R^1 及び R^2 は、式 (I) について定義した通りである]

を臭化エチルと反応させ、次いで酸で場合によって処理し、

塩基は、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム及び水酸化カリウムからなる群から選択されることを特徴とする、上記方法。

【請求項 2】

R^1 がメチルを表し、

R^2 が 3 , 4 - ジクロロフェニルを表す

請求項 1 に記載の方法。

【請求項 3】

塩基として、粉末の水酸化カリウムを使用することを特徴とする、請求項 1 又は 2 に記載の方法。

【請求項 4】

相間移動触媒として、テトラアルキルアンモニウム又はテトラアルキルホスホニウム塩を使用することを特徴とする、請求項 1 から 3 までの一項に記載の方法。

【請求項 5】

相間移動触媒として、硫酸水素テトラアルキルアンモニウムを使用することを特徴とする、請求項 4 に記載の方法。

【請求項 6】

希釈剤として、芳香族炭化水素、場合によってハロゲン化された脂肪族炭化水素、又はエーテルを使用することを特徴とする、請求項 1 から 5 までの一項に記載の方法。

【請求項 7】

希釈剤として、トルエン、ジクロロメタン、又は 1 , 2 - ジメトキシエタンを使用することを特徴とする、請求項 6 に記載の方法。

【請求項 8】

前記反応が - 10 ~ + 90 の範囲の温度で行われることを特徴とする、請求項 1 から 7 までの一項に記載の方法。

【請求項 9】

5 ~ 180 分以内に臭化エチルを計量供給し、得られた反応混合物をさらに 30 ~ 180 分間攪拌することを特徴とする、請求項 1 から 8 までの一項に記載の方法。

【請求項 10】

1 当量の式 (II) に対して、0.75 ~ 100 当量の臭化エチルを加えることを特徴とする、請求項 1 から 9 までの一項に記載の方法。

【請求項 11】

1 当量の式 (II) に対して、2.5 ~ 100 当量の塩基を加えることを特徴とする、請求項 1 から 10 までの一項に記載の方法。

【請求項 12】

1 当量の式 (II) に対して、0.01 ~ 0.5 当量の相間移動触媒を加えることを特徴とする、請求項 1 から 11 までの一項に記載の方法。

【請求項 13】

式 (II) の化合物の臭化エチルとの反応が終了した後、この反応混合物に水を添加し、相を分離し、その有機相を水で洗浄し、減圧下で蒸発させ、且つその残渣を、任意のさらなる精製なしで対応する酸で処理することを特徴とする、請求項 1 から 12 までの一項に記載の式 2 (I) の - (エトキシメチル) - トロパン誘導体の塩を調製する方法。